

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 07-165693

(43)Date of publication of application : 27.06.1995

(51)Int.Cl. C07C251/86
A01N 37/52
A01N 43/36
A01N 43/40
A01N 43/84
C07C313/18
C07C327/56
C07D295/12

(21)Application number : 06-216273

(71)Applicant : ROHM & HAAS CO

(22)Date of filing : 09.09.1994

(72)Inventor : JACOBSON RICHARD M

(30)Priority

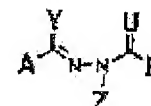
Priority number : 93 118915 Priority date : 09.09.1993 Priority country : US

(54) AMIDRAZONE COMPOUND AND INSECTICIDAL COMPOSITION CONTAINING IT

(57)Abstract:

PURPOSE: To obtain the subject compound useful for controlling insects which destroy cultivated plant crops, ornamental plants or forestry plants, especially lepidopterons, and an insecticidal composition containing it.

CONSTITUTION: The subject compound is a compound of the formula (wherein A and B are each aryl or aromatic heterocyclyl; U is O or S; Y is disubstituted amino; and Z is 3-9C cycloalkyl-substituted 3-9C alkyl), its agriculturally acceptable diastereomer, enantiomer or salt, or an insecticidal composition containing the compound. A preferable example of the compound is N-(4-bromobenzoyl)-morpholine N2-benzoyl-N2-t-butylhydrazone, N-(4-ethylbenzoyl)-amino-N2-(3,5- dimethylbenzoyl)-N2-t-butylhydrazone or the like.



AN4

(19)日本国特許庁 (J P)

(12) 公 開 特 許 公 報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平7-165693

(43)公開日 平成7年(1995)6月27日

(51)Int.Cl. ⁶	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 C 251/86		8829-4H		
A 0 1 N 37/52				
43/36		B		
43/40	1 0 1	P		
43/84	1 0 1			

審査請求 未請求 請求項の数11 O L (全 17 頁) 最終頁に続く

(21)出願番号	特願平6-216273	(71)出願人	590002035 ローム アンド ハース カンパニー ROHM AND HAAS COMPA NY アメリカ合衆国 19106-2399 ペンシル バニア州 フィラデルフィア, インディペ ンデンス モール ウェスト 100
(22)出願日	平成6年(1994)9月9日	(72)発明者	リチャード マーチン ジェイコブソン アメリカ合衆国ペンシルバニア州チャル フォント, ディアールバス ロード 11
(31)優先権主張番号	1 1 8 9 1 5	(74)代理人	弁理士 浅村 皓 (外3名)
(32)優先日	1993年9月9日		
(33)優先権主張国	米国 (U S)		

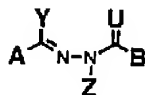
(54)【発明の名称】 アミドラゾン化合物およびそれを含有する殺虫組成物

(57)【要約】

【目的】 本発明は、秀れた殺虫性を有するアミドラゾ
ン化合物およびそれを含有する殺虫組成物を提供する。

【構成】 式

【化1】



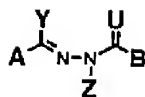
〔式中、Aは、アリールまたは芳香族ヘテロシクリルで
あり、Bは、アリールまたは芳香族ヘテロシクリルであ
り、Uは、酸素または硫黄であり、Yは、ジ置換アミノ
(NR¹ R²) (式中、R¹ およびR² は、独立的に、
水素またはWから選ばれた置換基である) であり、そし
てZは、任意的に、同じかまたは異なった (C₃ -
C₉) シクロアルキルの1個または2個で置換された、
直鎖または分枝鎖の (C₃ - C₉) アルキルである〕を
有する化合物、およびそれを含有する殺虫組成物。

1

【特許請求の範囲】

【請求項1】 式

【化1】



【式中、

Aは、アリールまたは芳香族ヘテロシクリルであり、

Bは、アリールまたは芳香族ヘテロシクリルであり、

Uは、酸素または硫黄であり、

Yは、ジ置換アミノ (NR¹ R²) であり、

【式中、

R¹ および R² は、独立的に、水素またはWから選ばれた置換基であり、そして前記Wは、(アルカノイルアル

キルチオ) カルボニル、(アルケニルチオ) カルボニ

ル、(アルキルチオ) カルボニル、(アルキルチオ) チ

オカルボニル、(アルキニルチオ) カルボニル、(フェ

ニルアルキルチオ) カルボニル、アルカノイルアルコ

シカルボニル、アルカノイルオキシ、アルケニル、アル

ケニルカルボニル、アルケニルオキシ、アルケニルオ

キシカルボニル、アルケニルスルホニル、アルケニルチ

オカルボニル、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、アル

コキシアルコキシアルコキシカルボニル、アルコキシ

アルコキシアルキル、アルコキシアルキルカルボニル、

アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニル(アルキ

ルチオ) カルボニル、アルコキシカルボニルアルコキシ

カルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、アルコ

キシカルボニルアルキルチオ、アルコキシカルボニルカル

ボニル、アルコキシカルボニルオキシ、アルコキシカル

ボニルチオ、アルキル、アルキルアミノカルボニル、ア

ルキルカルボニル、アルキルカルボニル(アルキルチ

オ) カルボニル、アルキルカルボニルオキシアルキル、

アルキリデンジオキシ、アルキルスルフィニル、アルキ

ルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニル、アルキ

ルスルホニルオキシ、アルキルチオ、アルキルチオアル

コキシカルボニル、アルキルチオアルキル、アルキルチ

オカルボニル、アルキニル、アルキニルカルボニル、ア

ルキニルオキシ、アルキニルオキシカルボニル、アルキ

ニルスルホニル、アミノ、芳香族ヘテロシクリル、アリ

ール、カルボキシ(アルキルチオ) カルボニル、カルボ

キシアルコキシカルボニル、カルボキシアルキル、シア

ノ、シクロアルキル、ジアルキルホスホリル、ジアルキ

ルチオホスホリル、ホルムアミド、ホルミル、ホルミル

オキシ、ハロ、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、ハロ

アルキル、ハロカルボニル、ヘテロシクリル、ヒドロキ

シ、ヒドロキシアルキル、イソシアノ、N、N-ジアル

キルアミノ、N、N-ジアルキルアミノカルボニル、

N、N-ジアルキルアミノカルボニルアミノ、N、N-

2

ジアルキルアミノカルボニルオキシ、N、N-ジアルキ

ルアミノスルホニル、N-(フェニルカルボニル) アミ

ノカルボニル、N-アルコキシカルボニル-N-アルキ

ルアミノ、N-アルキルアミノカルボニル、N-アルキ

ルアミノスルホニル、N-アルキルカルボニル-N-ア

ルキルアミノ、N-アルキルカルボニルアミノ、N-ホ

ルミル-N-アルキルアミノ、N-ホルミルアミノ、N-

モノアルキルアミノ、N-モノアルキルアミノカルボ

ニル、N-モノアルキルアミノカルボニルアミノ、N-

モノアルキルアミノカルボニルオキシ、N-モノアルキ

ルアミノスルホニル、N-フェニル-N-アルキルアミ

ノカルボニル、N-フェニルカルボニルアミノ、ナフチ

ル、ニトロ、フェニル、フェニルアルケニルカルボニ

ル、フェニルアルコキシ、フェニルアルコキシカルボ

ニル、フェニルアルキル、フェニルアルキルカルボニ

ル、フェニルアルキルチオカルボニル、フェニルアルキ

ニルカルボニル、フェニルカルボニル、フェニルオキシ、

フェニルオキシカルボニル、フェニルスルホニル、フェ

ニルチオ、フェニルチオカルボニル、ピリジロキシ、で

あり}、そしてZは、任意的に、同じかまたは異なった

(C₁ - C₉) シクロアルキルの1個または2個で置換された、直鎖または分枝鎖の(C₁ - C₉) アルキルで

ある]を有する化合物、およびそのような化合物の農業

上許容されるジステレオマーおよび鏡像異性体、およ

びそのような化合物の農業上許容される塩。

【請求項2】 AおよびBは、それぞれ、ハロゲン、メ

チルおよびエチルから独立的に選ばれた1-3個の置換

基によって独立的に任意的に置換されたフェニルで

あり、Zは、分枝鎖(C₄ - C₇) アルキルであり、U

は、酸素であり、そしてYは、1-モルホリノ、1-ピ

ペリジノ、またはジ(C₁ - C₃) アルキルアミノであ

る、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】 Aは、4-プロモフェニルまたは4-エ

チルフェニルであり、Bは、フェニルまたは3, 5-ジ

メチルフェニルであり、Yは、1-モルホリノ、1-ピ

ペリジノ、またはジメチルアミノであり、そしてZは、

t-ブチルである、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】 N-(4-エチルベンゾイル)-アミン

N²-(3, 5-ジメチルベンゾイル)-N²-t-ブ

チルヒドラゾンから選ばれる、請求項3の化合物。

【請求項5】 請求項1に記載の化合物の有害生物防除

有効量を含む、組成物。

【請求項6】 鱗翅目(order Lepidopt

era)の虫を有害生物防除するために有効な請求項5

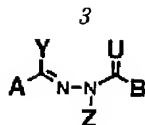
に記載の組成物。

【請求項7】 請求項1に記載の化合物の農業上許容さ

れる塩。

【請求項8】 式

【化2】



〔式中、

Aは、アリールまたは芳香族ヘテロシクリルであり、

Bは、アリールまたは芳香族ヘテロシクリルであり、

Uは、酸素または硫黄であり、

Yは、ピペリジノ、モルホリノ、およびピロリジノから選ばれ、かつピペリジノ、モルホリノ、およびピロリジノのそれぞれは、任意的に、少なくとも1つの(C₁ - C₆.)アルキルで置換されており、そしてZは、任意的に、同じかまたは異なった(C₃ - C₉.)シクロアルキルの1個または2個で置換された、直鎖または分枝鎖の(C₃ - C₉.)アルキルである]を有する化合物、およびそのような化合物の農業上許容されるジアステレオマーおよび鏡像異性体、およびそのような化合物の農業上許容される塩。

【請求項9】 $N - (4\text{-プロモベンゾイル}) - \text{モルホリン} N^2 - \text{ベンゾイル} - N^2 - t\text{-ブチルヒドラゾン}$ 、
 $N - (4\text{-プロモベンゾイル}) - \text{モルホリン} N^2 - (3, 5\text{-ジメチルベンゾイル}) - N^2 - t\text{-ブチルヒドラゾン}$ 、
 $N, N\text{-ジメチルベンズアミド} N^2 - (3, 5\text{-ジメチルベンゾイル}) - N^2 - t\text{-ブチルヒドラゾン}$ 、
 $N - (4\text{-エチルベンゾイル}) - \text{モルホリン} N^2 - (3, 5\text{-ジメチルベンゾイル}) - N^2 - t\text{-ブチルヒドラゾン}$ 、
 $N - (4\text{-エチルベンゾイル}) - \text{ピペリジン} N^2 - (3, 5\text{-ジメチルベンゾイル}) - N^2 - t\text{-ブチルヒドラゾン}$ 、および
 $N - (4\text{-エチルベンゾイル}) - \text{ピロリジン} N^2 - (3, 5\text{-ジメチルベンゾイル}) - N^2 - t\text{-ブチルヒドラゾン}$ から選ばれた、請求項8に記載の化合物。

【請求項10】 請求項8に記載の化合物の農業上許容される塩。

【請求項 11】 虫の生息地または虫に、請求項 1 または 8 の化合物の殺虫有効量を施用することから成る、虫の防除方法。

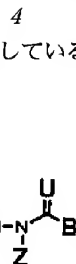
【発明の詳細な説明】

【0001】 発明の背景

本発明は、アミドラゾン (amidrazones)、 40
殺虫性アミドラゾン組成物、およびそのような組成物を
使用する方法、に関する。

【0002】大きな活性、よりよい選択性、望ましくない環境への低い影響、低い製造コスト、および多くの既知殺虫剤に対して抵抗性のある虫に対する有効性、を示す化合物のために要望されるようないくつかの要因のために、秀れた殺虫性および望ましくない毒性が低いことを組み合わせる有する化合物の探究が続けられている。

【０００３】本発明の化合物は、栽培された植物の作物、観賞植物、および林業における植物を破壊する中を 50



防除するための有用性を有している。

【0004】発明の概要

本発明により、式

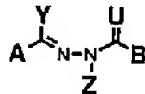
【化3】

【0005】〔式中、Aは、アリールまたは芳香族ヘテロシクリル (aromatic heterocycl y l) であり、Bは、アリールまたは芳香族ヘテロシクリルであり、Uは、酸素または硫黄であり、Yは、ジ置換アミノ (NR¹ R²) (式中、R¹ およびR² は、独立的に、選ばれた置換基であり、または、R¹ およびR² は、それらが結合している窒素と共に、5-または6-員環を形成しており) であり、Zは、(C₁ - C₉) アルキル、分枝 (C₃ - C₉) アルキル、または同じかまたは異なった (C₃ - C₉) シクロアルキルの1個または2個で置換された (C₁ - C₉) アルキルである〕を有する化合物、およびそのような化合物の農業上許容されるジアステレオマー (diastereomers) および鏡像異性体 (enantiomers) 、およびそのような化合物の農業上許容される塩、が提供される。

【0006】発明の態様

本発明により、式

【化4】



【0007】〔式中、Aは、アリールまたは芳香族ヘテロシクリルであり、Bは、アリールまたは芳香族ヘテロシクリルであり、Uは、酸素または硫黄であり、Yは、ジ置換アミノ ($\text{NR}^1 \text{R}^2$) (式中、 R^1 および R^2 は、独立的に、水素、またはWから選ばれた置換基であり、または R^1 および R^2 は、それらが結合している窒素と共に、5-または6-員環、好ましくはピペリジノ、モルホリノまたはピロリジノ、を形成しており、ピペリジノ、モルホリノまたはピロリジノの夫々は、任意的に、少なくとも1個の ($\text{C}_1 - \text{C}_6$) アルキルを有しており)、そしてZは、任意的に、同じかまたは異なった ($\text{C}_3 - \text{C}_9$) シクロアルキルの1個または2個で置換された、直鎖または分枝鎖の ($\text{C}_3 - \text{C}_9$) アルキルである〕を有する化合物、およびそのような化合物の農業上許容されるジアステレオマーおよび光学異性体、およびそのような化合物の農業上許容される塩、が提供される。

【0008】前記Wは、(アルカノイルアルキルチオ)カルボニル、(アルケニルチオ)カルボニル、(アルキ

5

ルチオ)カルボニル、(アルキルチオ)チオカルボニル、(アルキニルチオ)カルボニル、(フェニルアルキルチオ)カルボニル、アルカノイルアルコキシカルボニル、アルカノイルオキシ、アルケニル、アルケニルカルボニル、アルケニルオキシ、アルケニルオキシカルボニル、アルケニルスルホニル、アルケニルチオカルボニル、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、アルコキシアルコキシアルコキシカルボニル、アルコキシアルコキシアルキル、アルコキシアルコキシカルボニル、アルコキシアルキル、アルコキシアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニル(アルキルチオ)カルボニル、アルコキシカルボニルアルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、アルコキシカルボニルアルキルチオ、アルコキシカルボニルカルボニル、アルコキシカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルチオ、アルキル、アルキルアミノカルボニル、アルキルカルボニル、アルキルカルボニル(アルキルチオ)カルボニル、アルキルカルボニルオキシアルキル、アルキリデンジオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニル、アルキルスルホニルオキシ、アルキルチオ、アルキルチオアルコキシカルボニル、アルキルチオアルキル、アルキルチオカルボニル、アルキニル、アルキニルカルボニル、アルキニルオキシ、アルキニルオキシカルボニル、アルキニルスルホニル、アミノ、芳香族ヘテロシクリル、アリール、カルボキシ(アルキルチオ)カルボニル、カルボキシアルコキシカルボニル、カルボキシアルキル、シアノ、シクロアルキル、ジアルキルホスホリル、ジアルキルチオホスホリル、ホルムアミド、ホルミル、ホルミルオキシ、ハロ、ハロアルケニル、ハロアルコキシ、ハロアルキル、ハロカルボニル、ヘテロシクリル、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、イソシアノ、N、N-ジアルキルアミノ、N、N-ジアルキルアミノカルボニル、N、N-ジアルキルアミノカルボニルアミノ、N、N-ジアルキルアミノカルボニルオキシ、N、N-ジアルキルアミノスルホニル、N-(フェニルカルボニル)アミノカルボニル、N-アルコキシカルボニル-N-アルキルアミノ、N-アルキルアミノカルボニル、N-アルキルアミノスルホニル、N-アルキルカルボニル-N-アルキルアミノ、N-アルキルカルボニルアミノ、N-ホルミル-N-アルキルアミノ、N-ホルミルアミノ、N-モノアルキルアミノ、N-モノアルキルアミノカルボニル、N-モノアルキルアミノカルボニルオキシ、N-モノアルキルアミノスルホニル、N-フェニル-N-アルキルアミノカルボニル、N-フェニルカルボニルアミノ、ナフチル、ニトロ、フェニル、フェニルアルケニルカルボニル、フェニルアルコキシ、フェニルアルコキシカルボニル、フェニルアルキル、フェニルアルキルカルボニル、フェニルアルキルチオカルボニル、フェニルアルキニルカルボニル、フェニルカルボニル、フェニルオキシ、フェニルオキシカルボニル、フェニルスルホニル、フェニルチオ、フェニルチオカルボニル、ピリジロキシ、である。

6

ル、フェニルカルボニル、フェニルオキシ、フェニルオキシカルボニル、フェニルスルホニル、フェニルチオ、フェニルチオカルボニル、ピリジロキシ、である。

【0009】”(アルカノイルアルキルチオ)カルボニル”は、($C_1 - C_6$)アルカノイル($C_1 - C_6$)アルキルチオカルボニル、好ましくは(アセチルメチルチオ)カルボニル、である。

【0010】”(アルケニルチオ)カルボニル”は、($C_3 - C_6$)アルケニルチオ)カルボニル、好ましくは(アリルチオ)カルボニル、である。

【0011】”(アルキルチオ)カルボニル”は、($C_1 - C_6$)アルキルチオ)カルボニル〔例えば、($C_1 - C_6$)アルキル-S-C(=O)-〕、好ましくは(メチルチオ)カルボニル、(エチルチオ)カルボニル、(n-プロピルチオ)カルボニル、または(n-ブチルチオ)カルボニル、である。”プロピル”は、ノルマルプロピル(normal)プロピル、すなわち直鎖プロピルである。

【0012】”(アルキルチオ)チオカルボニル”は、($C_1 - C_6$)アルキルチオ)チオカルボニル〔例えば、($C_1 - C_6$)アルキル-S-C(=S)-〕、好ましくは(メチルチオ)チオカルボニル、である。

【0013】”(アルキニルチオ)カルボニル”は、($C_3 - C_6$)アルキニルチオ)カルボニル、好ましくは(プロパルギルチオ)カルボニル、である。

【0014】”(フェニルアルキルチオ)カルボニル”は、(フェニル($C_1 - C_6$)アルキルチオ)カルボニル、好ましくは(ベンジルチオ)カルボニル、である。

【0015】”アルカノイルアルコキシカルボニル”は、($C_1 - C_6$)アルカノイル($C_1 - C_6$)アルコキシカルボニル、好ましくはアセチルメトキシカルボニル、である。

【0016】”アルカノイルオキシ”は、($C_1 - C_6$)アルカノイルオキシ、好ましくはアセトキシ、である。

【0017】”アルケニル”は、($C_2 - C_6$)アルケニル、好ましくはビニルおよびアリル、である。

【0018】”アルケニルカルボニル”は、($C_2 - C_6$)アルケニルカルボニル、好ましくはビニルカルボニル、1-メチルビニルカルボニル、2-メチルビニルカルボニル、2,2-ジメチルビニルカルボニルおよび1,2,2-トリクロロビニルカルボニル、である。

【0019】”アルケニルオキシ”は、($C_3 - C_6$)アルケニルオキシ、好ましくはアリルオキシおよびブ-3-テンオキシ(but-3-enoxy)、である。

【0020】”アルケニルオキシカルボニル”は、($C_3 - C_6$)アルケニルオキシカルボニル”は、($C_3 - C_6$)アルケニルオキシカルボニル、好ましくはアリルオキシカルボニルおよびブ-3-テンオキシカルボニル、である。

【0021】"アルケニルスルホニル"は、(C₂ - C₆) アルケニルスルホニル、好ましくはビニルスルホニルおよびアリルスルホニル、である。

【0022】"アルケニルチオカルボニル"は、(C₃ - C₆) アルケニルチオカルボニル、好ましくはアリルチオカルボニル、である。

【0023】"アルコキシ"は、(C₁ - C₆) アルコキシ、好ましくはメトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、sec-ブトキシ、イソブトキシおよびt-ブトキシ、である。

【0024】"アルコキシアルコキシ"は(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、好ましくはメトキシメトキシおよび2-メトキシエトキシ、である。

【0025】"アルコキシアルコキシアルコキシカルボニル"は、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル、好ましくは2-(2-(メトキシ)エトキシ)エトキシカルボニル、である。

【0026】"アルコキシアルコキシアルキル"は、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキル、好ましくは2-メトキシエトキシメチル、である。

【0027】"アルコキシアルコキシカルボニル"は、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル、好ましくはメトキシエトキシカルボニル、である。

【0028】"アルコキシアルキル"は、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキル、好ましくはメトキシメチルおよび2-メトキシメチル、である。

【0029】"アルコキシアルキルカルボニル"は、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキルカルボニル、好ましくはメトキシメチルカルボニル、である。

【0030】"アルコキシカルボニル"は、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル、好ましくはメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロピルオキシカルボニル、イソプロピルオキシカルボニル、n-ブチルオキシカルボニル、イソブチルオキシカルボニル、t-ブチルオキシカルボニル、n-ペンチルオキシカルボニル、シアノメトキシカルボニル、2-シアノエトキシカルボニル、2-プロモエトキシカルボニル、2-クロロエトキシカルボニル、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル、2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニル、3-プロモプロピルオキシカルボニル、3-クロロプロピルオキシカルボニルまたは4-クロロブチルオキシカルボニル、である。

【0031】"アルコキシカルボニル(アルキルチオ)カルボニル"は、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル((C₁ - C₆) アルキルチオ)カルボニル、好ましく

は(メトキシカルボニルメチルチオ)カルボニル、である。

【0032】"アルコキシカルボニルアルコキシカルボニル"は、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル、好ましくはエトキシカルボニルメトキシカルボニルおよびエトキシカルボニルエトキシカルボニル、である。

【0033】"アルコキシカルボニルアルキル"は、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル(C₁ - C₆) アルキル、好ましくはメトキシカルボニルメチルおよびエトキシカルボニルメチル、である。

【0034】"アルコキシカルボニルアルキルチオ"は、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル(C₁ - C₆) アルキルチオ、好ましくはメトキシカルボニルメチルチオおよびエトキシカルボニルメチルチオ、である。

【0035】"アルコキシカルボニルカルボニル"は、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニルカルボニル、好ましくはメトキシカルボニルカルボニルおよびエトキシカルボニルカルボニル、である。

【0036】"アルコキシカルボニルオキシ"は、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニルオキシ、好ましくはメトキシカルボニルオキシおよびエトキシカルボニルオキシ、である。

【0037】"アルコキシカルボニルチオ"は、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニルチオ、好ましくはメトキシカルボニルチオおよびエトキシカルボニルチオ、である。

【0038】"アルキル"は、直鎖または分枝鎖のアルキル基を意味し、特にことわりがなければ、特定されたものは、好ましくは(C₁ - C₆) アルキル、更に好ましくはメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチルまたはn-ペンチル、である。

【0039】"アルキルアミノカルボニル"は、モノ(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、好ましくはメチルアミノカルボニル、またはジ(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、好ましくはジメチルアミノカルボニル、である。

【0040】"アルキルカルボニル"は、(C₁ - C₆) アルキルカルボニル、好ましくはメチルカルボニル(アセチル)、エチルカルボニル、n-プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、n-ブチルカルボニル、イソブチルカルボニル、t-ブチルカルボニル、n-ペンチルカルボニル、クロロメチルカルボニル、トリクロロメチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、3-クロロプロピルカルボニル、4-クロロブチルカルボニル、ペンタフルオロエチルカルボニル、またはヘプタフルオロプロピルカルボニル、である。

【0041】"アルキルカルボニル(アルキルチオ)カ

ルボニル”は、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル ($(C_1 - C_6)$ アルキルチオ) カルボニル、好ましくは (メチルカルボニルメチルチオ) カルボニル、である。

【0042】”アルキルカルボニルオキシアルキル”は、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニルオキシ ($C_1 - C_6$) アルキル、好ましくは2- (メチルカルボニルオキシ) エチルまたはメチルカルボニルオキシメチル、である。

【0043】”アルキリデンジオキシ”は、($C_1 - C_4$) アルキリデンジオキシ、好ましくはメチレンジオキシおよびエチレンジオキシ、である。

【0044】”アルキルスルフィニル”は、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル、好ましくはメチルスルフィニル、である。

【0045】”アルキルスルフィニルアルキル”は、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル ($C_1 - C_6$) アルキル、好ましくは2- (メチルスルフィニル) エチル、である。

【0046】”アルキルスルホニル”は、($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル、好ましくはメチルスルホニル、 n -ブチルスルホニル、クロロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、または2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニル、である。

【0047】”アルキルスルホニルオキシ”は、($C_1 - C_6$) アルキルスルホニルオキシ、好ましくはメチルスルホニルオキシ、である。

【0048】”アルキルチオ”は、($C_1 - C_{10}$) アルキルチオ、好ましくはメチルチオ、 n -プロピルチオ、 n -ブチルチオ、または3-シアノプロピルチオ、である。

【0049】”アルキルチオアルコキシカルボニル”は、($C_1 - C_6$) アルキルチオ ($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル、好ましくはメチルチオメトキシカルボニル、である。

【0050】”アルキルチオアルキル”は、($C_1 - C_6$) アルキルチオ ($C_1 - C_6$) アルキル、好ましくはメチルチオメチル、2- (メチルチオ) エチル、または2- (エチルチオ) エチル、である。

【0051】”アルキルチオカルボニル”は、($C_1 - C_6$) アルキルチオカルボニル、好ましくはチオアセチル、である。

【0052】”アルキニル”は、($C_1 - C_6$) アルキニル、好ましくはプロパルギル、およびブツ-2-イン-1-イル (but-2-yn-1-yl)、である。

【0053】”アルキニルカルボニル”は、($C_1 - C_6$) アルキニルカルボニル、好ましくはプロパルギルカルボニル、である。

【0054】”アルキニルオキシ”は、($C_3 - C_6$) アルキニルオキシ、好ましくはプロパルギルオキシ、お

およびブツ-3-イノキシ (but-3-ynoxy)、である。

【0055】”アルキニルオキシカルボニル”は、($C_3 - C_6$) アルキニルオキシカルボニル、好ましくはプロパルギルオキシカルボニル、である。

【0056】”アルキニルスルホニル”、($C_3 - C_6$) アルキニルスルホニル、好ましくはプロパルギルスルホニル、である。

【0057】”芳香族ヘテロシクリル”は、完全に不飽和の5員または6員のヘテロ環式環であり、これらの環は、独立的に、酸素、窒素または硫黄から選ばれた1個、2個または3個のヘテロ原子を含有し、かつ残りの環原子は炭素原子である。好ましいものは、フリル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、トリアジニル、オキサゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、チエニル、およびチアゾリル、である。ヘテロシクリル環は、任意的に、Wから独立的に選ばれた1個または2個の置換基によって置換される。好ましくは、ニトロ；($C_1 - C_6$) アルキル、好ましくはメチルまたはエチル；($C_1 - C_6$) ハロアルキル、好ましくはトリフルオロメチル；($C_1 - C_6$) アルコキシ、好ましくはメトキシ；およびハロ、好ましくはクロロ、である。

【0058】”アリール”は、芳香族 ($C_6 - C_{10}$) 炭素環式構造、好ましくは不飽和の1環式または2環式の ($C_6 - C_{10}$) 炭素環式構造、更に好ましくはフェニルまたはフナチル、である。アリール基は、任意的であるが、Wから独立的に選ばれた1個または2個の置換基によって置換される。好ましくは、ニトロ；($C_1 - C_6$) アルキル、好ましくはメチルまたはエチル；($C_1 - C_6$) ハロアルキル、好ましくはトリフルオロメチル；($C_1 - C_6$) アルコキシ、好ましくはメトキシ；およびハロ、好ましくはクロロ、である。

【0059】”カルボキシ (アルキルチオ) カルボニル”は、カルボキシ ($(C_1 - C_6)$ -アルキルチオ) カルボニル、好ましくはカルボキシ (メチルチオ) カルボニル、である。

【0060】”カルボキシアルコキシカルボニル”は、カルボキシ ($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル、好ましくはカルボキシエトキシカルボニル、またはカルボキシプロポキシカルボニル、である。

【0061】”カルボキシアルキル”は、カルボキシ ($C_1 - C_6$) アルキル、好ましくはカルボキシメチル、である。

【0062】”シクロアルキル”は、($C_3 - C_{12}$) 炭素脂環式構造およびアルキル置換炭素脂環、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、およびメンチル、を意味する。

【0063】”ジアルキルホスホリル”は、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルホスホリル、好ましくはジエチルホスホリル、である。

【0064】"ジアルキルチオホスホリル"は、ジ(C₁ - C₆)アルキルチオホスホリル、好ましくはジエチルチオホスホリル、である。

【0065】"ハロ"は、ブromo、クロロ、フルオロ、およびアイオド、を意味し；"ハロゲン"は、ブロマイド、クロライド、フルオライド、およびアイオダイド、である。

【0066】"ハロアルケニル"は、(C₂ - C₆)アルケニル、好ましくは2, 2-ジブromobinyl, 2, 2-ジクロロbinyl, 2, 2-フルオロbinyl, または2-ブromobinyl, である。

【0067】"ハロアルコキシ"は、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、好ましくはトリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ、または1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロピロキシ、である。

【0068】"ハロアルキル"は、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、好ましくはトリフルオロメチル、2-クロロエチル、または2-ブromoeチル、である。

【0069】"ハロカルボニル"は、好ましくはクロロカルボニル、である。

【0070】"ヘテロシクリル"は、完全に飽和の、部分的に不飽和の、または完全に不飽和の、5員または6員のヘテロ環式環であり、これらの環は、独立的に、酸素、窒素または硫黄から選ばれた1個、2個または3個のヘテロ原子を含有し、かつ残りの環原子は炭素原子である。好ましいものは、ピペリジル、モルホリニル、テトラヒドロフランニル、ピロリジニル、フリル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、トリアジニル、オキサゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、チエニル、およびチアゾリル、である。ヘテロシクリル環は、任意的に、Wから独立的に選ばれた1個または2個の置換基によって置換される。好ましくはニトロ；(C₁ - C₆)アルキル、好ましくはメチルまたはエチル；(C₁ - C₆)ハロアルキル、好ましくはトリフルオロメチル；(C₁ - C₆)アルコキシ、好ましくはメトキシ；およびハロ、好ましくはクロロ、である。

【0071】"ヒドロキシアルキル"は、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、好ましくはヒドロキシメチル、1-ヒドロキシエチル、または2-ヒドロキシエチル、である。

【0072】"N, N-ジアルキルアミノ"は、N, N-ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、好ましくはジメチルアミノまたはジエチルアミノ、である。

【0073】"N, N-ジアルキルアミノカルボニル"は、N, N-ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、好ましくはジメチルアミノカルボニル、である。

【0074】"N, N-ジアルキルアミノカルボニルアミノ"は、N, N-ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニルアミノ、好ましくはジメチルアミノカルボニル

アミノ、である。

【0075】"N, N-ジアルキルアミノカルボニルオキシ"は、N, N-ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニルオキシ、好ましくはジメチルアミノカルボニルオキシ、である。

【0076】"N, N-ジアルキルアミノスルホニル"は、N, N-ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、好ましくはジメチルアミノスルホニル、である。

【0077】"N-(フェニルカルボニル)アミノカルボニル"は、好ましくはN-(2, 6-ジフルオロフェニルカルボニル)アミノカルボニル、である。

【0078】"N-アルコキシカルボニル-N-アルキルアミノ"は、N-(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル-N-(C₁ - C₆)アルキルアミノ、好ましくはN-メトキシカルボニル-N-メチルアミノ、N-メトキシカルボニル-N-プロピルアミノ、およびN-エトキシカルボニル-N-エチルアミノ、である。

【0079】"N-アルキルアミノカルボニル"は、N-(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、好ましくはメチルアミノカルボニル、である。

【0080】"N-アルキルアミノスルホニル"は、N-(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、好ましくはN-メチルアミノスルホニル、である。

【0081】"N-アルキルカルボニル-N-アルキルアミノ"は、N-(C₁ - C₆)アルキルカルボニル-N-(C₁ - C₆)アルキルアミノ、好ましくはN-アセチル-N-メチルアミノ、N-エチルカルボニル-N-プロピルアミノ、およびN-プロピルカルボニル-N-エチルアミノ、である。

【0082】"N-アルキルカルボニルアミノ"は、N-(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、好ましくはアセチルアミノ、である。

【0083】"N-ホルミル-N-アルキルアミノ"は、N-ホルミル-N-(C₁ - C₆)アルキルアミノ、好ましくはN-ホルミル-N-メチルアミノ、およびN-ホルミル-N-プロピルアミノ、である。

【0084】"N-モノアルキルアミノ"は、N-モノ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、好ましくはN-メチルアミノ、である。

【0085】"N-モノアルキルアミノカルボニル"は、N-モノ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、好ましくはN-メチルアミノカルボニル、である。

【0086】"N-モノアルキルアミノカルボニルアミノ"は、N-モノ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニルアミノ、好ましくはN-メチルアミノカルボニルアミノ、である。

【0087】"N-モノアルキルアミノカルボニルオキシ"は、N-モノ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニルオキシ、好ましくはN-メチルアミノカルボニルオキシ、である。

【0088】“N-モノアルキルアミノスルホニル”は、N-モノ(C₁-C₆)アルキルアミノスルホニル、好ましくはN-メチルアミノスルホニル、である。

【0089】“N-フェニル-N-アルキルアミノカルボニル”は、N-フェニル-N-(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル、好ましくはN-メチル-N-(フェニル)アミノカルボニル、である。

【0090】“N-フェニルカルボニルアミノ”は、好ましくはN-(4-クロロフェニル)カルボニルアミノ、である。

【0091】“ナフチル”は、任意的に、Wから独立的に選ばれた1個または2個の置換基によって置換されているナフチルである。好ましくは、ニトロ；(C₁-C₆)アルキル、好ましくはメチルまたはエチル；(C₁-C₆)ハロアルキル、好ましくはトリフルオロメチル；(C₁-C₆)アルコキシ、好ましくはメトキシ；およびハロ、好ましくはクロロ、である。

【0092】“フェニル”は、任意的に、Wから独立的に選ばれた1個または2個の置換基によって置換されているフェニルである。好ましい置換基は、メチル、エチル、プロピル、t-ブチル、トリフルオロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロ、プロモ、クロロ、アイオド、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、n-プロピロキシ、イソプロピロキシ、sec-ブチロキシ、n-ブチロキシ、イソブチロキシ、n-ペンチロキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ、プロモジフルオロメトキシ、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロピロキシ、アリルオキシ、プロパルギルオキシ、メトキシメトキシ、ベンジルオキシ、2-フェニルエトキシ、フェニルオキシ、2-クロロ-4-トリフルオロメチルフェニルオキシ、5-クロロ-2-ピリジルオキシ、5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジルオキシ、3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジルオキシ、メチルアミノカルボニルオキシ、N, N-ジメチルアミノカルボニルオキシ、アセトキシ、メトキシカルボニルオキシ、メチルスルホニルオキシ、トリフルオロメチルスルホニルオキシ、メチルチオ、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルチオ、2-エトキシエチル、アセチル(すなわち、メチルカルボニル)、エチルカルボニル、イソプロピルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、イソプロピルオキシカルボニル、ニトロ、メチルスルホニル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルスルホニル、フェニル、シアノ、イソシアノ、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、ホルミルアミノ、アセトアミド、トリフルオロアセトアミド、フェニルカルボニルアミノ、4-クロロフェニルカルボニルアミノ、メチルアミノカルボニルアミノ、およびジ-n-プロピルアミノカルボニルアミノ、である。フェニル上の好ましい位置は、4-位置であ

り、例えば好ましいメチルフェニルは4-メチルフェニルである。

【0093】“フェニルアルケニルカルボニル”は、フェニル(C₂-C₆)アルケニルカルボニル、好ましくはフェニルビニルカルボニル(シンナモイル)、である。

【0094】“フェニルアルコキシ”は、(C₇-C₁₁)フェニルアルコキシ、好ましくはベンジルオキシおよび3-フェニルプロポキシ、である。

10 【0095】“フェニルアルコキシカルボニル”は、フェニル(C₁-C₆)アルコキシカルボニル、好ましくはベンジルオキシカルボニルまたは2-フェニルエトキシカルボニル、である。

【0096】“フェニルアルキル”は、フェニル(C₁-C₆)アルキル、好ましくはベンジルまたは2-フェニルエチル、である。

【0097】“フェニルアルキルカルボニル”は、フェニル(C₁-C₆)アルキルカルボニル、である。

20 【0098】“フェニルアルキルチオカルボニル”は、フェニル(C₁-C₆)アルキルチオカルボニル、である。

【0099】“フェニルアルキニルカルボニル”は、フェニル(C₂-C₆)アルキニル、である。

【0100】“フェニルカルボニル”は、非置換フェニルカルボニルまたは置換フェニル、好ましくは4-クロロフェニルカルボニル、4-メチルフェニルカルボニル、または4-トリフルオロメチルフェニルカルボニル、である。

30 【0101】“フェニルオキシ”は、好ましくはフェノキシまたは4-クロロフェノキシ、である。

【0102】“フェニルオキシカルボニル”は、好ましくはフェノキシカルボニルまたは4-クロロフェノキシカルボニル、である。

【0103】“フェニルスルホニル”は、好ましくはフェニルスルホニルまたは4-メチルフェニルスルホニル、である。

【0104】“フェニルチオ”は、非置換フェニルチオおよび置換フェニルチオ、好ましくは2-ニトロフェニルチオ、である。

40 【0105】“フェニルチオカルボニル”は、(C₆-C₁₀)フェニルチオカルボニル、好ましくはフェニルチオカルボニルおよび4-クロロフェニルチオカルボニル、である。

【0106】“ピリジルオキシ”は、好ましくは2-ピリジルオキシ、5-クロロ-2-ピリジルオキシ、5-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ、または3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ、である。

50 【0107】“農業上許容される塩(Agronomically acceptable salts)”に

は、酸付加塩、好ましくは塩酸塩、硫酸塩、および重硫酸塩；金属塩、好ましくはナトリウム、カリウム、カルシウム、およびマグネシウム；アンモニウム塩、好ましくはイソプロピルアンモニウム；およびトリアルキルスルホニウム塩、好ましくはトリメチルスルホニウム、が含まれる。

【0108】“有害生物防除有効量 (Pestically effective amount)”は、所望の有害生物防除を発揮するのに十分な活性物質の量であり、好ましくは、有害生物の個体数またはそのような有害生物の個体数によって加えられた作物の損害のいずれかの対照群と比較して、有意の減少を生じさせる量、更に好ましくは、25%の減少を生じさせる量、いっそう更に好ましくは、少なくとも90%の減少を生じさせる量、を意味する。

【0109】ある種の場合においては、本発明の化合物は、光学的な鏡像異性形態 (enantiomorphs) およびジアステレオマー (diastereomers) を生じる非対称の中心を有している。また、本発明の化合物は、塩または金属錯体を生成することができる酸部分または塩基部分を有している。本発明には、そのような鏡像異性体等、塩および金属錯体も含まれている。

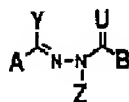
【0110】本発明の好ましい態様の1つにおいては、AおよびBは、それぞれ、ハロゲン好ましくはブromo、アルコキシ好ましくはメトキシ、そしてアルキル好ましくはメチルまたはエチル、から独立的に選ばれた、1~3個好ましくは1~2個の置換基によって独立的に任意的に置換されたフェニルである。好ましくは、Aは、4-置換フェニル、更に好ましくは4-ブromoフェニルまたは4-エチルフェニル、である。好ましくは、Bは、フェニルまたは3,5-ジメチルフェニル、である。また、この好ましい態様においては、Zは、分枝鎖 (C₄-C₇) アルキル、好ましくはtert-ブチル、tert-アミル、またはneo-ペンチル、であり；Uは、酸素または硫黄、好ましくは酸素、であり；そしてYは、1-モルホリノ、1-ピペリジノまたはジ (C₁-C₃) アルキルアミノ、好ましくはジメチルアミノ、である。それ故、好ましい化合物は、AおよびBは、それぞれ、ハロゲン、メチルおよびエチルから独立的に選ばれた1~3個の置換基によって独立的に任意的に置換されたフェニルであり、Zは、分枝鎖 (C₄-C₇) アルキルであり、Uは、酸素であり、そしてYは、1-モルホリノ、1-ピペリジノ、またはジ (C₁-C₃) アルキルアミノ、である。

【0111】好ましい化合物は次の化合物である：N-(4-ブromoベンゾイル)-モルホリンN²-ベンゾイル-N²-tert-ブチルヒドラゾン；N-(4-ブromoベンゾイル)-モルホリンN²-(3,5-ジメチルベンゾイル)-N²-tert-ブチルヒドラゾン；N,N-ジメチルベンズアミドN²-(3,5-ジメチルベンゾイル)-N²-tert-ブチルヒドラゾン；N-(4-エチルベンゾイル)-モルホリンN²-(3,5-ジメチルベンゾイル)-N²-tert-ブチルヒドラゾン；N-(4-エチルベンゾイル)-ピペリジンN²-(3,5-ジメチルベンゾイル)-N²-tert-ブチルヒドラゾン；N-(4-エチルベンゾイル)-ピロリジンN²-(3,5-ジメチルベンゾイル)-N²-tert-ブチルヒドラゾン；およびN-(4-エチルベンゾイル)-アミンN²-(3,5-ジメチルベンゾイル)-N²-tert-ブチルヒドラゾン。

【0112】次の第1表に、本発明の化合物の例を列挙した。ただし、本発明をこれらに制限することは意図されていない。

【表1】

第1表



例No.	A	B	Y	Z	U
1	4-ブromoフェニル	フェニル	1-モルホリノ	tert-ブチル	O
2	4-ブromoフェニル	3,5-ジメチルフェニル	1-モルホリノ	tert-ブチル	O
3	4-エチルフェニル	3,5-ジメチルフェニル	ジメチルアミノ	tert-ブチル	O
4	4-エチルフェニル	3,5-ジメチルフェニル	1-モルホリノ	tert-ブチル	O
5	4-エチルフェニル	3,5-ジメチルフェニル	1-ピペリジノ	tert-ブチル	O
6	4-エチルフェニル	3,5-ジメチルフェニル	1-ピロリジノ	tert-ブチル	O
7	4-エチルフェニル	3,5-ジメチルフェニル	アミノ	tert-ブチル	O

【0113】本発明の組成物および化合物は、防護すべき場所、例えば虫によって被害をうける有利な植物のまわりの領域または植物上の領域、または被害を防護すべき植物、に直接施用することができる。本発明の化合物および組成物は、接触有害生物防除剤 (contact pesticides) として、また浸透有害生物防除剤 (systemic pesticides) として、使用することができる。

【0114】本発明の実施においては、活性化化合物を、前記化合物が植物によって吸収され、植物の他の部分に場所を換え、そして植物の部分の摂取することによって有害生物 (pest) または虫 (insects) によって最後には摂取されてしまう、土壌 (soil) または葉 (foliage) に、施用することができる。この施用方法は、“システムック (systemic)” 施用と称されている。別法として、本発明の活性化化合物を、土壌に施用してもよいし、また土壌の中において防護すべき虫および他の有害生物と接触させてもよい。この施用方法は、“土壌 (soil)” 施用と称されている。その他の別法においては、活性化化合物を、葉を餌としている虫およびその他の有害生物の被害から救うべき植物の葉に施用してもよい。

【0115】本発明の化合物は、組成物または配合物の形態において使用することができる。組成物および配合物の例は、American Chemical Societyの出版物“Pesticidal Formation Research”, (1969), Advances in Chemistry Series No. 86, Wade Van Valkenburg著、およびMarcel Dekker, Inc.の出版物“Pesticide Formulations”, (1973), Wade Van Valkenburg編集、に見出すことができる。これらの組成物および配合物においては、活性物質を、従来の有害生物防除剤の組成物または配合物において使用されているタイプの、従来の不活性の農業上許容される (すなわち、植物に対しては親和性があり、および/または、有害生物防除剤としては不活性である) 有害生物防除剤用の希釈剤または増量剤 (extenders)、例えば固体担体物質または液体担体物質、と混合させる。農業上許容される担体は、活性成分の効果を減じることなしに組成物中の活性成分を溶解し、分散し、または拡散するのに使用することができ、かつそれら自体は、土壌、装置、所望の植物、または農業の環境に対して有意の害を有さない、任意の物質である。また、所望により、界面活性剤、安定剤、消泡剤および流れ防止剤 (anti drift agents) のような助剤を組み合わせ使用してもよい。

【0116】本発明による組成物および配合物の例には、水性溶液および水性分散液、油性溶液および油性分

散液、ペースト、粉剤 (dusting powders)、湿潤性粉末 (wetttable powders)、乳化性濃厚物、流動性剤、粒剤、餌剤、転化性乳化剤 (invert emulsions)、エアゾール組成物 (aerosol composition)、およびくん蒸用キャンドル (fumigating candles)、がある。湿潤性粉末、ペースト、流動性剤および乳化性濃厚物は、濃厚な製剤であり、使用前または使用中において水で希釈する。餌剤は、一般的に、虫の食物または虫をひきつける力のある物質を含んでおり、そして本発明の少なくとも1種の化合物を含んでいる調製物である。転化性乳化剤は、主に、空気施用のために用いられる。その場合には、広い領域が比較的少量の調製物で処理され、かつ噴霧用装置中において、噴霧操作の直前または噴霧中においてさえ、活性物質の油性溶液または油性分散液の中に水を乳化することによって造ることができる。

【0117】本発明の組成物および配合物は、既知の方法により造ることができる。例えば、活性物質を、従来の有害生物分散性液体希釈剤担体および/または分散性固体担体を用いて、かつ任意的に、担体ビヒクル用助剤例えば従来の有害生物防除剤用界面活性剤—これには乳化剤および/または分散剤が含まれる—を用いて、増量させることにより、造ることができる。また水を希釈剤として用いたときは、有機溶媒を、助剤溶媒として加えてもよい。

【0118】本発明の活性化化合物は、単独でまたはお互いの、および/または、固体および/または液体の分散性担体ビヒクルとの、および/または、他の既知の親和性活性剤、例えば植物防護剤例えば他の殺虫剤、殺節足動物剤、殺線虫剤、殺菌剤、殺バクテリア剤、殺そ(鼠)剤 (rodenticides)、除草剤、肥料、生長剤、相乗剤との、混合物の形態において、使用することができる。

【0119】本発明の組成物においては、活性化化合物は、実質的に、約0.001~99重量%の量において存在させる。貯蔵または輸送に適した組成物のためには、活性成分の量は、好ましくは、混合物の約0.5~90重量%であり、更に好ましくは約1~75重量%である。直接施用またはフィールド施用 (field application) に適した組成物は、一般的に、混合物の約0.001~95重量%、好ましくは約0.005~90重量%、更に好ましくは約0.001~75重量%、を含んでいる。

【0120】本発明の活性化化合物は、通常使用される方法による殺虫剤噴霧剤、例えば高ガロン液圧噴霧剤、低ガロン液圧噴霧剤、超低容量噴霧剤 (ultra-low volume sprays)、エアブラスト噴霧剤 (airblast sprays)、空中噴霧剤 (aerial sprays)、および粉剤 (dus

ts)、として施用することができる。

【0121】また、本発明は、本発明の少なくとも1種の化合物の戦う量または毒性量(すなわち、有害生物殺生有効量)を、前述したように単独でまたは担体ビヒクル(組成物または配合物)と共に、有害生物と接触させて処理する、有害生物の殺生方法、防護方法、または有害生物と戦う方法、も企図している。本明細書および特許請求の範囲において使用されている用語“接触”は、

(a) そのような有害生物、および(b) それらの相応する習性(すなわち、防護すべき場所、例えば、生長作物または作物が生長する場所)の少なくとも1つに、本発明の活性化化合物を、単独でまたは組成物または配合物の1つの構成成分として、施用することを意味している。

【0122】また、前述の成分に加えて、本発明による調製物は、この種類の調製物に通常使用される他の物質を含有させることができる。例えば、滑剤例えばステアリン酸カルシウムまたはステアリン酸マグネシウムを、湿潤性粉末または粒化すべき混合物に添加することができる。更に、例えば、接着剤例えばポリビニルアルコール・セルロース遊導体、またはその他のコロイド性物質例えばカゼイン、を添加して、防護すべき表面に対する有害生物防除剤の接着性を改良することができる。

【0123】また、本発明による組成物および配合物に、既知の有害生物を防除する化合物を含有させてもよい。次の既知の殺虫性化合物、殺菌性化合物、および殺ダニ性化合物は、そのような組み合わせ調製物に使用するために適している：

【0124】アセフェート(acephate)、アセチオン(acethion)、アセトキソン(acetoxon)、アルディカルブ(aldicarb)、アルドキシカルブ(aldoxycarb)、アルドリン(aldrin)、アレスリン(allethrin)、アリキシカルブ(allyxycarb)、アルファシベルメスリン(alphacypermethrin)、アミジチオン(amidithion)、amitraz(アミトラツ)、アムルアー(amlure)、アネトール(anethol)、アゼチオン(azethion)、アジンフォスーエチル(azinphos-ethyl)、アジンフォスーメチル(azinphos-methyl)、アゾシクロチン(azocyclotion)、バシルススリンギンシス(bacillus thuringiensis)、BCPE、ベンディオカルブ(bendiocarb)、ベンサルタップ(bensultap)、ベンゾキシメート(benzoximate)、ベンジルアセテート(benzyl acetate)、ベンジルベンゾエート(benzul benzoate)、BHC、ビフェンスリン(bifenthrin)、ピナバクリル(binapacryl)、ボミル

(bomyl)、BPMC、ブromoフォス(bromophos)、ブromoフォスーエチル(bromophos-ethyl)、ブromoプロピレート(bromopropylate)、ブフェンカルブ(bufencarb)、ブプロフェジン(buprofezin)、ブタカルブ(butacarb)、プトカルボキシム(butocarboxim)、プトネート(butonate)、プトキシカルボキシム(butoxycarboxim)、カルシウムアーセネート(calcium arsenate)、カルバリル(carbaryl)、カルボフラン(carbofuran)、カルボフェノチオン(carbophenothion)、カルボスルファン(carbosulfan)、カルタップ(cartap)、クロールダン(chlordane)、クロールデコン(chlordecone)、クロールディメフォルム(chlordimeform)、クロールフェネトール(chlorfenethol)、クロールフェンソン(chlorfensson)、クロールフェンサルファイド(chlorfensulphide)、クロールフェンビンフォス(chlorfenvinphos)、クロールメフォス(chlormephos)、クロールベンズイレート(chlorbenzilate)、クロールプロピレート(chlorpropylate)、クロールフォキシム(chlorphoxim)、クロールピリフォス(chlorpyrifos)、クロールピリフォスメチル(chlorpyrifos methyl)、クロールチオフォス(chlorthiophos)、クロフェンテジン(clofentezine)、CPCBS、CPMC、クロトキシフォス(crotoxyphos)、クルフォメート(crufomate)、クリオライト(cryolite)、クフラネブ(cufraneb)、シアノフェンフォス(cyanofenphos)、シアノフォス(cyanophos)、シアントエート(cyanthoate)、シフルスリン(cyfluthrin)、シヘキサチン(cyhexatin)、シベルメスリン(cypermethrin)、シフェノスリン(cyphenothrin)、シロマジン(cyromazine)、DAEP、DDT、DDVP、デルタメスリン(deltamethrin)、デメトン(demeton)、デメトン-S-メチル(demeton-S-methyl)、デメトン-O-メチル(demeton-O-methyl)、デメトン-S(demeton-S)、デメトン-S-メチルスルフォキシド(demeton-S-methyl sulfoxide)、デメフィオン-O(demephion-O)、デメフィオン-S(demephion-S)、ジアリフォー(dialifor)、ジアジノン(diazinon)、ジカプソン(dicapthon)、ジクロフェンチオン

(dichlofenthion)、ジコフォル (dicofol)、ジクロトフォス (dicrotophos)、ジエルドリン (dielldrin)、ジエノクロール (dienochlor)、ジフルベンズロン (diflubenzuron)、ジヒドロロテノン (dihydorotenone)、ジメフォクス (dimefox)、ジメタン (dimetan)、ジメトエート (dimethoate)、ジメスリン (dimethrin)、ジネックス (dinx)、ジニトロフェノール (dinitrophenol)、ジノブトン (dinobuton)、ジノカップ (dino 10 cap)、ジオキサベンゾフォス (dioxabenzofos)、ジオキサカルブ (dioxacarb)、ジオキサチオン (dioxathion)、ジスパルルアー (disparlure)、ジサルフトン (disulfoton)、DMCP、DNOC、d-トランス アレスリン (d-trans allethrin)、エンドサルファン (endosulfan)、エンドチオン (endothion)、エンドリン (endrin)、エンティス (entice)、EPBP、EPN、エスフェンバレレート (esfenvalerate)、エチオフエンカルブ (ethiofencarb)、エチオン (ethion)、エトエート メチル (ethoate-methyl)、エトプロプ (ethoprop)、エトリムフォス (ctrimfos)、フェナミフォス (fenamiphos)、フェナザフロア (fenazafloor)、フェンブタティン-オキサイド (fenbutatin oxide)、フェニトロチオン (fenitrothion)、フェノキシカルブ (fenoxycarb)、フェンプロパスリン (fenpropathrin)、フェンソン (fenson)、フェンサルフォチノン (fensulfathion)、フェンチオン (fenthion)、フェンバレレート (fenvalerate)、フルベンズイミン (flubenzimine)、フルシスリネート (flucythrinate)、フルエンエチル (fluenethyl)、フルフェノクスロン (flufenoxuron)、フルバリネート (fluvalinate)、フォノフォス (fonofos)、フォルメタネート ハイドロクロ 40 ライド (formetanate hydrochloride)、フォルモチオン (formothion)、フォスメチラン (fosmethilan)、フォステタン (fosthietan)、フラチオカルブ (furathiocarb)、フレスリン (furethrin)、グランドルアー (grandlure)、ヘプタクロール (heptachlor)、HE TP、ヘキシチアゾックス (hexythiazox)、ヒドラメチルノン (hydramethylnon)、ハイドロブレン (hydroprene)、IP 50

SP、イサゾフォス (isazophos)、イソベンザン (isobenzan)、イソフェンフォス (isofenphos)、イソプロカルブ (isoproc carb)、イソプロチオラン (isoprothiolane)、イソチオエート (isothioate)、イソキサチオン (isoxathion)、ヨードフェンフォス (jodfenphos)、キノブレン (kinoprene)、レッド アーセネート (lead arsenate)、レプトフォス (leptophos)、レサアン (lethane)、リンダン (lindane)、リスィダチオン (lythidathion)、マラチオン (malathion)、マズイドックス (mazidox)、メカルバム (mecarbam)、メカルフォン (mecarphon)、メナゾン (menazon)、メフォスフォラン (mephosfolan)、メタミドフォス (methamidophos)、メチダチオン (methidathion)、メチオカルブ (methiocarb)、メトミル (methomyl)、メトブレン (methoprene)、メトキシクロール (methoxychlor)、メチル パラチオン (methyl parathion)、メチル フェンカプトン (methyl phencapton)、メビンフォス (mevinphos)、メキサカルバート (mexacarbato)、MIPC、ミレックス (mirex)、モノクロトフォス (monocrotophos)、MTMC、ネールド (naled)、ニコチン (nicotine)、ノナクロール (nonachlor)、オメトエート (omethoate)、オベックス (ove 30 x)、オキサミル (oxamyl)、オキシデプロフス (oxydeprofos)、オキシジスルフトン (oxydisulfoton)、オキシチオキノックス (oxythioquinox)、パラオクソン (paraoxon)、パラチオン (parathion)、パリス グリーン (paris green)、パーメスリン (permethrin)、パーサン (pethane)、フェンカプトン (phencapton)、フェントエート (phentoate)、フォレート (phorate)、フォサローン (phosalone)、フォスフォラン (phosfolan)、フォスメット (phosment)、フォスニクロール (phosnichlor)、フォスファミドン (phosphamidon)、フォキシム (phoxim)、ピリミカルブ (pirimicarb)、ピリミフォス-エチル (pirimiphos-ethyl)、ピリミフォス-メチル (pirimiphos-methyl)、ピリフェネート (pilifenate)、プロフェノフォス (profenofos)、プロメカルブ (promecarb)、プロパルギッテ 50 (propargite)、プロベタムフォス (pro

petamphos)、プロボクスル(propoxu
r)、プロチダチオン(prothidathio
n)、プロチオフォス(prothiophos)、プ
ロトエート(prothoate)、PTMD、ピリダ
ベン(pyridaben)、ピリダフェンチオン(p
yridaphenthion)、キナルフォス(qu
inalphos)、レスメスリン(resmethr
in)、ロンネル(ronnell)、ロテノン(ro
tenone)、リアニア(ryania)、s-ビオ
アレスリン(bioallethrin)、サリチオン 10
(salithion)、シュラダン(shrada
n)、ナトリウム フルオシリケート(sodium
fluosilicate)、ソファミド(sopha
mide)、スルフォテップ(sulfotepp)、
スルプロフォス(sulprofos)、テフルスリン
(tefluthrin)、テムフォス(temeph
os)、TEPP、ターブフォス(terbufo
s)、テトラクロロビンフォス(tetrachlor
vinphos)、テトラジフォン(tetradif
on)、テトラメスリン(tetramethri 20
n)、テトラサル(tetrasul)、タリウム サ
ルフエート(thallium sulfate)、チ
オカルボキシム(thiocarboxime)、チオ
シクラム-ハイドロジェンオキサレート(thiocy
clam-hydrogenoxalate)、チオメ
トン(thiometon)、トルクロフォス-メチル
(tolclofos-methyl)、トキサフェン
(toxaphene)、トリアゾフォス(triaz
ophos)、トリクロルフオン(trichlorf
on)、トリクロロネート(trichloronat 30
e)、トリフルムロン(triflumuron)、ト
リメタカルブ(trimethacarb)、バミドチ
オン(vamidothion)、キシリルカルブ(x
yllylcarb)。

【0125】また、本発明の殺虫剤と組み合わせること
ができる殺菌剤には次のものが包含される：

(a) ジチオカルバメートおよびその誘導体、例えば
フェルバム(ferbam)、ジイラム(zira
m)、マネブ(maneb)、マンコゼブ(manco
zeb)、ジネブ(zineb)、プロピネブ(pro
pineb)、メタム(metham)、ティラム(t
hiram)、ジネブ(zineb)の錯体、およびポ
リエチレン チウニム ジスルフィド(polyeth
ylenethiuram disulfide)、ダ
ソメット(dazomet)、およびこれらと銅塩との
混合物；

(b) ニトロフェノール誘導体、例えばジノキャップ
(dinocap)、ピナバクリル(binapacr
yl)、および2-sec-ブチル-4, 6-ジニトロ
フェニル イソプロピル カーボネート；

(c) ヘテロ環式構造、例えばカプタン(capta
n)、フォルベット(folpet)、グリオジン(g
lyodine)、アニラジン(anilazin
e)、ジタリムフォス(ditalimfos)、4-
ブチル-1, 2, 4-トリアゾール、5-アミノ-1-
[ビス(ジメチルアミノ)ホスフィニル]-3-フェニ
ル-1, 2, 4-トリアゾール、エトラジアゾール(e
tradiazole)、ジチアノン(dithian
on)、チオキノックス(thioquinox)、
ベノミル(benomyl)、チアベンダゾール(th
iabendazole)、4-(2-クロロフェニル
ヒドラゾノ)-3-メチル-5-イソキサゾール、ビン
クロゾリン(vinclozolin)、イプロジオン
(iprodione)、プロシミドン(procym
idone)、トリアジメノール(triadimen
ol)、トリアジメフォン(triadimefo
n)、ビタータノール(bitertanol)、プロ
クロールアツ(prochloraz)、フェナスイモ
ル(fenasimol)、ビス-(p-クロロフェニ
ル)-3-ピリジンメタノール、ビス-(p-クロロフ
ェニル)-5-ピリジンメタノール、トリアリモール
(triarimol)、フルトリアフォール(flu
triafol)、フルスィラゾール(flusila
zole)、プロピコナゾール(propiconaz
ole)、エタコナゾール(ctaconazol
e)、ミクロブタニル(myclobutanil)、
アルファ-[2-(4-クロロフェニル)エチル]-
アルファ-フェニル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-
1-プロパンニトリル、ヘキサコナゾール(hexa
conazole)、シプロコナゾール(cyproco
nazole)、ターブコナゾール(terbucon
azole)、ジニコナゾール(diniconazo
le)、フルオロイミド、ピリジン-2-チオール-1
-オキサイド、8-ヒドロキシキノリン サルフエート
およびその金属塩類、2, 3-ジヒドロ-5-カルボキ
シアニリド-6-メチル-1, 4-オキサチン-4,
4-ジオキサイド、2, 3-ジヒドロ-5-カルボキ
シアニリド-6-メチル-1, 4-オキサチン、シス-
N-[(1, 1, 2, 2-テトラクロロエチル)チオー
ル]-4-シクロヘキセン-1, 2-ジカルボキシイミ
ド、シクロヘキシイミド、デヒドロ酢酸、カプタフォー
ル(captafol)、エチリモル(ethirim
ol)、キノメチオネート(quinomethion
ate)、D, L-メチル-N-(2, 6-ジメチルフ
ェニル)-N-(2'-メトキシアセチル)アラニン
メチル エステル、D, L-メチル-N-(2, 6-ジ
メチルフェニル)-N-クロロアセチル-D, L-2-
アミノブチロラクトン、D, L-N-(2, 6-ジメチ
ルフェニル)-N-(フェニルアセチル)アラニン 50
メチル エステル、5-メチル-5-ビニル-3-(3,

5-ジクロロフェニル)-2, 4-ジオキソ-1, 3-オキサゾリジン、3-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-メチル-5-(メトキシメチル)-1, 3-オキサゾリジン-2, 4-ジオン、3-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-イソプロピルカルバモイルヒダントイン、2-シアノ-[N-(エチルアミノカルボニル)-2-メトキシイミノ]アセトアミド、フェンプロピモルフ、フェンプロピジン、2, 6-ジメチル-N-トリデシルモルホリン、ドデモルフ(dodemorph)、およびトリフォリン(triforine);

(d) 種々なハロゲン化殺菌剤、例えばクロラニル(chloranil)、ジクロン(dichlone)、クロロネブ(chloroneb)、トリカムバ(tricamba)、TCPN、ジクロラン(dichloran)、2-クロロ-1-ニトロプロパン、ポリクロロニトロベンゼン、例えばペンタクロロニトロベンゼン(PCNB)、およびテトラフルオロジクロロアセトン;

(e) 殺菌性抗生物質、例えばグリセオフラビン、カスガマイシン、ポリオキシン、バリダマイシン、およびストレプトマイシン;

(f) 銅ベースの殺菌剤、例えば水酸化銅、酸化第一銅、塩基性塩化第二銅、塩基性炭酸銅、テレフタル酸銅、ナフテン酸銅、およびボルドー混合物(Bordeaux mixture); および

(g) 種々な殺菌剤、例えばドジン(dodine)、フェニル酢酸水銀、N-エチルマーキュリー-1, 2, 3, 6-テトラヒドロ-3, 6-エンドメタノ-3, 4, 5, 6, 7, 7-ヘキサクロロフタルイミド、フェニルマーキュリックモノエタノールアンモニウムラクトート、p-ジメチルアミノベンゼンナトリウムスルホネート、メチルイソチオシアネート、1-チオシアノ-2, 4-ジニトロベンゼン、1-フェニルチオセミカルバジド、ニッケル含有化合物、カルシウムシアナミド、ライム硫黄(lime sulfur)、チオファナート-メチル、フルトラニル(flutolanil)、エジノフォス(edinophos)、イソプロチオラン、プロペナゾール、およびトリシクラゾール。

【0126】本発明の化合物は、種々な反応計画により造ることができる。次の実施例には、中間体および前述の第1表に示された最終化合物の製造について例示されているが、しかしこれらに限定されることは意図されていない。

【0127】実施例A

中間体、N¹-t-ブチル-N¹-(3, 5-ジメチルベンゾイル)-ヒドラジンの製造

【0128】機械式攪拌機および還流冷却器を備えた3リットルフラスコに、t-ブチルヒドラジン塩酸塩160g(1.28モル)、水160ml(8.89モ

ル)、および50%水酸化ナトリウム水溶液108g(1.35モル)、を仕込んだ。アセトン100g(1.72モル)をゆっくり加え、1時間攪拌した。反応混合物を、塩化メチレン600mlで希釈し、次いで50%水酸化ナトリウム水溶液120g(1.5モル)と氷120gの混合物を注意深く加えた。次いで、この反応混合物に、塩化3, 5-ジメチルベンゾイル169g(1.0モル)を、1.75時間かけて滴下しながら加え、1時間追加して攪拌した。濃塩酸5mlおよび50%水酸化ナトリウム108g(1.35モル)を含有する水500mlを、分離用漏斗に移し、それぞれ300mlの水で2回以上洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧で濃縮し、うす青黄色油(pale yellow oil)298g(1.14モル)を得た。

【0129】前述の単離したうす黄色油298g、トルエン600ml、水400ml、および酢酸5.0g(0.056モル)を、機械式攪拌機およびディーンスタークトラップ(Dean Stark trap)を備えた3リットルフラスコに仕込み、5時間還流させた。この時間の間、新しいトルエンおよび水を加えて、ディーンスタークトラップを排出することによって失われたそれらと置き換えた。反応混合物を希水酸化ナトリウム水溶液で中和し、速やかにブライン(brine)で1回洗った。室温に冷却することによって沈殿した生成物を濾過し、ヘキサンと共に粉碎した。白色固体153gを得た。融点125℃~127℃であった。

【0130】実施例B

N-(4-プロモベンゾイル)-モルホリンN²-ベンゾイル-N²-t-ブチルヒドラゾンの製造

【0131】(a) N-(4-プロモチオベンゾイル)-モルホリン
モルホリン40g(460ミリモル)に、4-プロモベンズアルデヒド18.56g(100ミリモル)および元素状の硫黄4.08g(125ミリモル)を加えた。この溶液を15分間還元させた。反応混合物を水に注入し、酢酸エチル1リットルで抽出した。酢酸エチル抽出物をブラインで洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で蒸発させ、次いでエチルエーテル/ヘキサンと共に粉碎し、生成物26.9gを得た。融点135℃~137℃であった。

【0132】(b) 1-(4-プロモベンゾイル)-モルホリンN²-t-ブチルヒドラゾン

実施例B-(a)において製造したN-(4-プロモチオベンゾイル)-モルホリン5.0g(18.7ミリモル)に、無水t-ブチルヒドラジン12.5g(142ミリモル)を加えた。混合物を、還流させて(浴温度~160℃)6時間加熱し、ウィークエンド(weekend)にかけて室温において攪拌し、次いで8時間追加して還流させた。反応物を室温に冷却し、塩化メチレンで希釈し、水洗した。塩化メチレン溶液を無水硫酸マグ

ネシウムで乾燥し、減圧で蒸発させ、エチルエーテル／ヘキサンと共に粉碎した。可溶性画分は、～10%の出発物質で汚染された生成物を含んでいた。

【0133】(c) N-(4-プロモベンゾイル)-モルホリンN²-ベンゾイル-N²-t-ブチルヒドラゾン

塩化メチレン15gに1-(4-プロモベンゾイル)-モルホリンN²-t-ブチルヒドラゾン2.0g(6.2ミリモル)を溶かした液に、無水重炭酸ナトリウム0.5g(6.0ミリモル)、5%重炭酸ナトリウム水溶液10ml(6.0ミリモル)、および塩化ベンゾイル0.95g(6.8ミリモル)を加えた。2相の溶液を室温において15分間攪拌し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、次いで減圧で蒸発させた。粗生成物を-5℃においてヘキサンから結晶させ、1:1エチルエーテル／ヘキサン中でシリカ上においてクロマトグラフィーにかけ、所望の生成物を得た。融点119℃～121℃であった。

【0134】実施例C

N-(4-プロモベンゾイル)-モルホリンN²-(3,5-ジメチルベンゾイル)-N²-t-ブチルヒドラゾンの製造

【0135】実質的に実施例Bの手順により、塩化ベンゾイルの代りに3,5-ジメチル塩化ベンゾイルを使用して、所望の生成物である油2.0gを得た。nmr(CDC1₃) δ1.49Hs, 2.36Hs, 3.24Hbs, 3.64Hm, 6.6-7.57Hm.

【0136】実施例D

N,N-ジメチルベンズアミドN²-(3,5-ジメチルベンゾイル)-N²-t-ブチルヒドラゾン

【0137】(a) N,N-ジメチル-4-エチルベンズアミド

水50gにジメチルアミン塩酸塩36.0g(442ミリモル)を溶解した。氷50gおよび50%水酸化ナトリウム溶液36g(450ミリモル)を加えた。内部温度を10℃以下に維持しながら、塩化4-エチルベンゾイル35g(208ミリモル)を加えた。その混合物を20分間攪拌し、エチルエーテルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で濃縮してN,N-ジメチル-4-エチルベンズアミド36.2gを得た。

【0138】(b) N,N-ジメチルイムモニウム-4-エチルベンゾイルクロライドクロライド

実施例D-(a)で製造したN,N-ジメチル-4-エチルベンズアミド3.5g(19.8ミリモル)および塩化チオニル3.0g(25ミリモル)を、塩化メチレン6gに溶解し、4時間還流させた。反応混合物を減圧下で蒸発させ、エチルエーテル／ヘキサンと共に粉碎して生成物2.5gを得た。

【0139】(c) N,N-ジメチルベンズアミドN²-(3,5-ジメチルベンゾイル)-N²-t-ブチルヒ

ラゾン

塩化メチレン10mlに、実施例D-(b)で得られたN,N-ジメチルイムモニウム-4-エチルベンゾイルクロライドクロライド2.5g(10.8ミリモル)および実施例Aから得られたN¹-t-ブチル-N¹-(3,5-ジメチルベンゾイル)-ヒドラジン2.5g(11.4ミリモル)を溶解した。トリエチルアミン2.5g(24.7ミリモル)を滴下しながら加えることにより、発熱が認められた。反応物を30分間攪拌し、減圧下で濃縮し、エチルエーテルと1M水酸化ナトリウム水溶液との間で分配させた。エチルエーテル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濃縮し、1:1エチルエーテル／ヘキサン中でシリカゲル上においてクロマトグラフィーにかけ、油2.0gを得た。nmr(CDC1₃) δ1.23Ht, 1.49Hs, 2.36Hs, 2.62Hq, 2.86Hs, 6.6-7.27Hm.

【0140】実施例E

N-(4-エチルベンゾイル)-モルホリンN²-(3,5-ジメチルベンゾイル)-N²-t-ブチルヒドラゾンの製造

【0141】(a) N-(4-エチルベンゾイル)-モルホリン

塩化メチレン25mlにモルホリン9.6g(0.11モル)を溶かして冷却した溶液に、塩化4-エチルベンゾイルを滴下しながら加えた。この反応物を30分間攪拌して白色沈殿物を生成させた。この混合物を、それぞれ水25mlを用いて3回水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で蒸発して黄色油10.6gを得た。

【0142】(b) N-モルホリニウム-4-エチルベンゾイルクロライドクロライド(N-morpholinium-4-ethylbenzoyl chloride chloride)

塩化メチレン10mlに、実施例E-(a)から得られたN-(4-エチルベンゾイル)-モルホリン1.1g(5.0ミリモル)を溶かした溶液に、塩化オキサリル2.5g(20.0ミリモル)を加えた。この混合物を1時間攪拌し、次いで減圧下で濃縮して固体残渣1gを得た。

【0143】(c) N-(4-エチルベンゾイル)-モルホリンN²-(3,5-ジメチルベンゾイル)-N²-t-ブチルヒドラゾン

塩化メチレン10mlに、実施例Aにおいて得られたN¹-t-ブチル-N¹-(3,5-ジメチルベンゾイル)-ヒドラジン1.0g(5.0ミリモル)およびトリエチルアミン1.0g(10.0ミリモル)を溶解させ、その溶液を氷水浴中で冷却した。この混合液に、実施例E-(b)において得られたN-モルホリニウム-4-エチルベンゾイルクロライドクロライド1.0gを塩化メチレン30mlに溶かした溶液を、3分間かけ

て滴下しながら加え、5分間攪拌した。この反応物を、それぞれ水50mlを用いて3回水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で蒸発し、1:4エチルエーテル/ヘキサン中でシリカゲル上においてクロマトグラフィーにかけ、所望の生成物、うすい黄色油 (pale yellow oil) を得た。nmr (CDCl₃) δ 1.23Ht, 1.49Hs, 2.36Hs, 2.82Hq, 3.24Hbs, 3.64Hm, 6.6-7.37Hm.

【0144】実施例F

N-(4-エチルベンゾイル)-ピペリジンN²-(3,5-ジメチルベンゾイル)-N²-t-ブチルヒドラゾンの製造

【0145】実質的に実施例Eの手順により、モルホリンをピペラジンで置き換えて、所望の生成物である灰色がかった白色固体を得た。融点100℃~102℃であった。

【0146】実施例G

N-(4-エチルベンゾイル)-ピロリジンN²-(3,5-ジメチルベンゾイル)-N²-t-ブチルヒドラゾンの製造

【0147】実質的に実施例Eの手順により、モルホリンをピロリジンで置き換えて、所望の生成物であるうすい黄色固体を得た。融点109℃~110℃であった。

【0148】実施例H

4-エチルベンズアミドN²-(3,5-ジメチルベンゾイル)-N²-t-ブチルヒドラゾンの製造

【0149】4-エチルベンゾニトリル2.7gに、実施例Aにおいて得られたN¹-t-ブチル-N¹-(3,5-ジメチルベンゾイル)-ヒドラジン4.0gおよび1-ブタノール50mlを加えた。得られた混合物を5時間還流させ、減圧下で濃縮して、水に溶けている固体を得、それを酢酸エチルで抽出した。得られた溶液を硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で濃縮して、所望の生成物5.6gを固体で得た。融点90℃~96℃であった。

【0150】本発明の化合物の強力な有害生物防除の初期活性および秀れた有害生物防除の残留活性に基づいて、本発明の化合物は、有害生物を防除するのに、低施用量で使用することができる。施用量は、種々の要因、例えば使用する物質、有害生物の種類、使用する配合物、有害生物で被害を受けた作物の状態、および一般の気象条件等に依存する。一般的に、農業および園芸における有害生物の防除のためには、1ヘクタール当り活性物質の約0.1g~約1000gに相当する施用量が使用され、そして1ヘクタール当り活性物質の約5g~約200gが好ましい。与えられた状況における正確な施用量は、日常的にきまっている手順によりきめることができ、かつ種々な要因、例えば使用する物質、有害生物の種類、使用する配合物、虫により被害をうけた作物の

状態、および一般の気象条件等に依存する。

【0151】本発明の化合物によって防除することができる代表的な有害生物には次のものが包含される：アメリカン コックローチ (American Cockroach) [ペリプラネタ アメリカナ (Periplaneta americana)]、ビーン リーフ ビートル (Bean Leaf Beetle) [セロトマ トリフルカタ (Cerotoma trifurcata)]、ビーン リーフ ローラー (Bean Leaf Roller) [ウルバヌス プロテウス (Urbanus proteus)]、ブラック カーペンター アーンツ (Black Carpenter Ant) [カンポノタス ペンシルバニカス (Camponotus pennsylvanicus)]、ブラック カットウォーム (Black Cutworm) [アグロティス イプシロン (Agrotis ipsilon)]、ボール ウィービル (Boll Weevil) [アントノマス グラディス グラディス (Anthonomus grandis grandis)]、コロラド ポテト ビートル (Colorado Potato Beetle) [レピノタルサ デセムリネアタ (Leptinotarsa decemlineata)]、フォール アーミイウォーム (Fall Armyworm) [スポドプテラ フルギペルダ (Spodoptera frugiperda)]、ジャーマン コックローチ (German Cockroach) [ブラテラ ゲルマニカ (Blattella germanica)]、グリーン ジューン ビートル (Green June Beetle) [コティニス ニティダ (Cotinis nitida)]、ハウス クリケット (House Cricket) [アクヘタ ドメスティカス (Acheta domesticus)]、ハウスフライ (House fly) [ムスカ ドメスティカ (Musca domestica)]、メキシカン ビーン ビートル (Mexican Bean Beetle) [エピラチナ パリベスティス (Epilachna varivestis)]、ポテト リーフ ボッパー (Potato Leaf Hopper) [エムポアスカ ファバエ (Empoasca fabae)]、レッド ハーベスター アーンツ (Red Harvester Ant) [ポゴノミルメ バルバタス (Pogonomyrmex barbatus)]、レッド インポートド ファイアー アーンツ (Red Imported Fire Ant) [ソレノプシス インビクタ (Solenopsis invicta)]、レッド レグド グラスボッパー (Redlegged Grasshopper) [メラノプス フェムルブルム (Melanopus femurrubrum)]、スーザン アーミイウォーム (Southern A

31

rmyworm) [スポドプテラ エリダニア (Spodoptera eridania)], スーザンコーン ロートウォーム (Southern Corn Rootworm) [ディアブロティカ ウンデシム プンクタタ ホバルディ (Diabrotica undecimpunctata howardi)], およびタバコ ブッドウォーム (Tobacco Budworm) [ヘリオディスピレスセンス (Heliothis virescens)]。

32

【0152】本発明の化合物は、有害生物防除活性を有しており、かつ有害生物特に鱗翅目 (order Lepidoptera) からの虫、の幼虫形態および成虫形態を防除することが可能であることが、生物学的な評価によって見出されている。当業者は、与えられた虫に対する与えられた化合物の活性を定める方法、および一般的なまたは選択的な有害生物防除効果を得るのに必要な施用量を定める方法、について知っているであろう。

フロントページの続き

(51) Int. Cl. ⁶	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 C 313/18		7419-4H		
327/56		7106-4H		
C 0 7 D 295/12	Z			